

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-523490(P2004-523490A)

【公表日】平成16年8月5日(2004.8.5)

【年通号数】公開・登録公報2004-030

【出願番号】特願2002-546496(P2002-546496)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 311/37

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/255

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/433

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 31/08

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 33/02

A 6 1 P 33/10

A 6 1 P 43/00

C 0 7 C 233/80

C 0 7 C 275/30

C 0 7 C 275/32

C 0 7 C 281/06

C 0 7 C 335/16

C 0 7 C 335/18

C 0 7 C 335/20

C 0 7 C 337/06

C 0 7 D 249/12

C 0 7 D 271/10

C 0 7 D 285/00

C 0 7 D 285/12

C 0 7 D 333/20

【F I】

C 0 7 C 311/37

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/255

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/433
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 27/06
 A 6 1 P 31/08
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 33/02
 A 6 1 P 33/10
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 C 0 7 C 233/80
 C 0 7 C 275/30
 C 0 7 C 275/32
 C 0 7 C 281/06
 C 0 7 C 335/16
 C 0 7 C 335/18
 C 0 7 C 335/20
 C 0 7 C 337/06
 C 0 7 D 249/12 5 0 5
 C 0 7 D 271/10
 C 0 7 D 285/00
 C 0 7 D 333/20
 C 0 7 D 285/12 A

【手続補正書】

【提出日】平成16年11月26日(2004.11.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

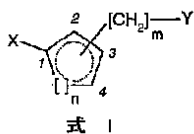
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

【化1】



及び薬剤として許容できるその誘導体

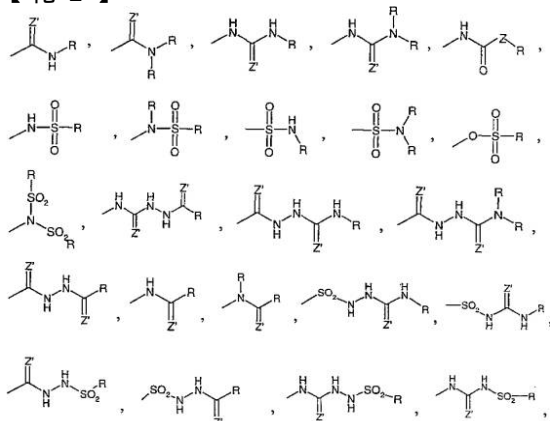
式中、 n は1又は2であって、飽和、部分飽和又は芳香族でありうる中央の5 - 6員炭素環が形成され、

m は0 - 3であり、

置換基 - $[CH_2]_m - Y$ は、上記の中央の炭素環の2, 3又は4の位置に結合しており、

X と Y は同一又は異なって、そして独立に、

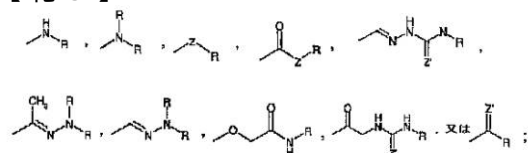
【化 2】



もしくはその組合せ、

又は C₁ - C₆ の直鎖もしくは分岐鎖のアルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、該アルキル、アルケニルもしくはアルキニルは 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、Y はさらに、Q、

【化 3】



であってもよく、

式中、Z' は O, S, N(CN), CH(NO₂) もしくは N(NO₂) であり、

Z は O もしくは S であり、そして

R は独立に

Q、

もしくは C₁ - C₆ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは 1 以上の炭素原子が O, N, NH, S, SO, もしくは SO₂ で置換されていてもよく、

そして、そこでは、飽和、部分飽和もしくは芳香族でありうる Q は、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、1 もしくはいくつかの位置が、独立にハロ、ヒドロキシル、メルカプチル、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよく、かつトリフルオロメチルもしくはシアノで置換されていてもよいアリールアミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよいアリールアミノ、C₁ - C₄ アルキルスルホニル、C₁ - C₄ アルキルチオ、C₁ - C₄ アルカノイル、オキシ、シアノ、カルボキシ、C₁ - C₆ アルキルもしくはアルニル、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₅ アルコシカルボニル、C₁ - C₄ アルケニルオキシ、フェノキシ、フェニル、シアノフェニル、ベンジルオキシ、ベンジル、アミノ、C₁ - C₄ アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、C₁ - C₄ アルキルカルバモイル、及びジ - (C₁ - C₄) アルキルカルバモイルよりなり、上記の個々の環は 5 - 6 員環であり、そして各複素環は O, N 及び S よりなる群から独立に選ばれた 1 - 6 個の異種原子がいかなる化学的に安定な順序及び酸化状態にある群から任意かつ独立に選ばれた置換基で置換されているものである、群から選ばれた置換基で置換されてもよい。

但し、R が Q、又は Q で置換された C₁ - C₆ アルキルもしくはアルケニル、又は Q で置換

されさらに 1 以上のヒドロキシルもしくはオキシ基で置換された $C_1 - C_6$ アルキルもしくはアルケニルであって、

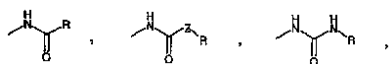
n は 2 であり、そして

m は 0 であり、そして

Y は前記の中央の炭素環の 3 の位置に結合している場合には、

X と Y の両方が

【化 4】



もしくはこれらの組合せではなく、

そして、さらに R が Q 、又は Q で置換された $C_1 - C_6$ アルキルもしくはアルケニル、又は Q で置換されさらに 1 以上のヒドロキシルもしくはオキシ基で置換された $C_1 - C_6$ アルキルもしくはアルケニルであって、

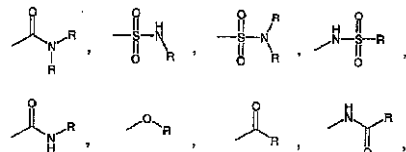
n は 2 であり、そして

m は 0 であり、そして

Y は前記の中央の炭素環の 3 の位置に結合している場合には、

X と Y の両方が

【化 5】

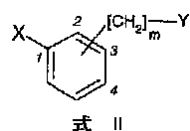


もしくはこれらの組合せではない。

【請求項 2】

次式の化合物

【化 6】



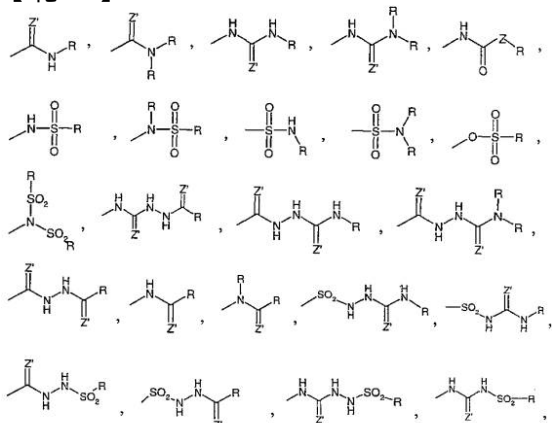
及び薬剤として許容できるその誘導体

式中、 m は 0 - 3 であり、

置換基 - $[CH_2]_m - Y$ は 2 又は 3 の位置に結合しており、

X と Y は同一又は異なって、そして独立に

【化 7】

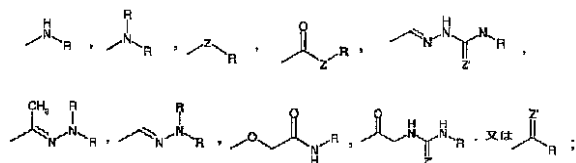


もしくはその組合せ、

又は $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖のアルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって

、該アルキル、アルケニルもしくはアルキニルは 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、
そして、Y はさらに、Q、

【化 8】



であっててもよく、

式中、Z' は O、S、N(CN)、CH(NO₂) もしくは N(NO₂) であり、

Z は O もしくは S であり、そして

R は独立に

Q、

もしくは C₁ - C₆ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは 1 以上の炭素原子が O、N、NH、S、SO、もしくは SO₂ で置換されていてもよく、

そして、そこでは、飽和、部分飽和もしくは芳香族でありうる Q は、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、1 もしくはいくつかの位置が、独立にハロ、ヒドロキシル、メルカプチル、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよく、かつトリフルオロメチルもしくはシアノで置換されていてもよいアリールアミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよいアリールアミノ、C₁ - C₄ アルキルスルホニル、C₁ - C₄ アルキルチオ、C₁ - C₄ アルカノイル、オキソ、シアノ、カルボキシ、C₁ - C₆ アルキルもしくはアルナニル、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₅ アルコシカルボニル、C₁ - C₄ アルケニルオキシ、フェノキシ、フェニル、シアノフェニル、ベンジルオキシ、ベンジル、アミノ、C₁ - C₄ アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、C₁ - C₄ アルキルカルバモイル、及びジ - (C₁ - C₄) アルキルカルバモイルよりなり、上記の個々の環は 5 - 6 員環であり、そして各複素環は O、N 及び S よりなる群から独立に選ばれた 1 - 6 個の異種原子がいかなる化学的に安定な順序及び酸化状態にある群から任意かつ独立に選ばれた置換基で置換されているものである、
群から選ばれた置換基で置換されてもよい。

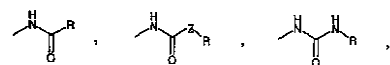
但し、R が Q、又は Q で置換された C₁ - C₆ アルキルもしくはアルケニル、又は Q で置換されさらに 1 以上のヒドロキシルもしくはオキソ基で置換された C₁ - C₆ アルキルもしくはアルケニルであって、

m は 0 であり、そして

Y は 3 の位置に結合している場合には

X と Y の両方が

【化 9】



もしくはこれらの組合せではなく、

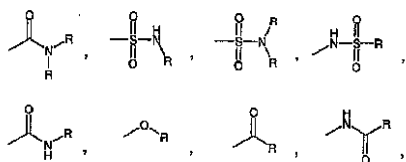
そして、さらに R が Q、又は Q で置換された C₁ - C₆ アルキルもしくはアルケニル、又は Q で置換されさらに 1 以上のヒドロキシルもしくはオキソ基で置換された C₁ - C₆ アルキルもしくはアルケニルであって、

m は 0 であり、そして

Y は 3 の位置に結合している場合には、

X と Y の両方が

【化 1 0】

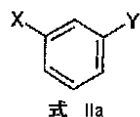


もしくはこれらの組合せではない。

【請求項 3】

次式の化合物

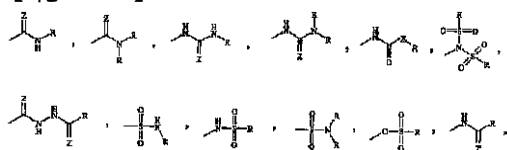
【化 1 1】



及び薬剤として許容できるその誘導体

式中、XとYは同一又は異って、そして独立に、

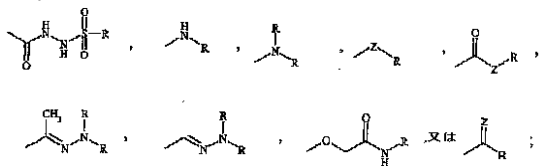
【化 1 2】



もしくはその組合せ、

又は $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、1もしくはいくつかの位置がQで置換されており、そして、1もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、Yはさらに、Q、

【化 1 3】



であってもよく、

式中、ZはOもしくはSであり、そして

Rは独立に

Q、

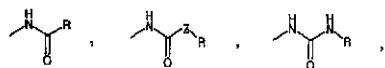
もしくは $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その1もしくはいくつかの位置がQで置換されており、そして、1もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは1以上の炭素原子がO、N、NH、S、SO、もしくは SO_2 で置換されていてもよく、

そして、そこでは、Qは、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、飽和、部分飽和もしくは芳香族であってもよく、そして1もしくはいくつかの位置がハロ、ヒドロキシ、メルカプチル、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、 $C_1 - C_6$ 直鎖もしくは分岐鎖のアルキルもしくはアルケニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシもしくはアルケニルオキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、アミノもしくはアセチルであって、個々の環は5 - 6員環であり、そして各複素環はO、N、Sもしくはその組合せからなる群より選ばれた1 - 6個の異種原子を含んでいる。

但し、

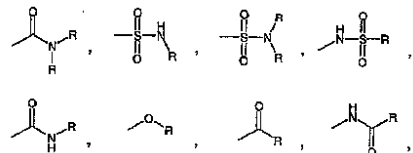
R が Q、又は Q で置換された $C_1 - C_6$ 直鎖もしくは分岐鎖アルキルもしくはアルケニル、又は Q で置換されさらに 1 以上のヒドロキシルもしくはオキシ基で置換された $C_1 - C_6$ 直鎖もしくは分岐鎖アルキルもしくはアルケニルである場合には、X と Y の両方が

【化 1 4】



もしくはこれらの組合せではなく、そして、さらに R が Q、又は Q で置換された $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖アルキルもしくはアルケニル、又は Q で置換されさらに 1 以上のヒドロキシルもしくはオキシ基で置換された $C_1 - C_6$ 直鎖もしくは分岐鎖アルキルもしくはアルケニルである場合には、X と Y の両方が

【化 1 5】

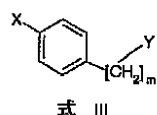


もしくはこれらの組合せではない。

【請求項 4】

次式の化合物

【化 1 6】

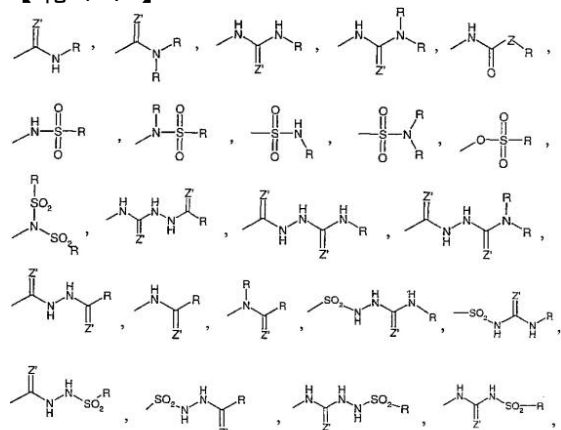


及び薬剤として許容できるその誘導体

式中、m は 0 - 3 であり、

X と Y は同一又は異なって、そして独立に、

【化 1 7】

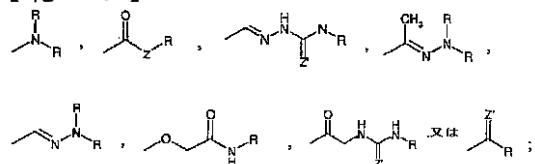


もしくはその組合せ、

又は $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖のアルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、該アルキル、アルケニルもしくはアルキニルは 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、

そして、Y はさらに、

【化 18】



であってもよく、

式中、Z' は O, S, N(CN), CH(NO₂) もしくは N(NO₂) であり、

Z は O もしくは S であり、そして

R は独立に

Q、

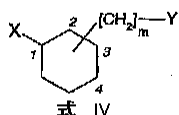
もしくは C₁ - C₆ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは 1 以上の炭素原子が O, N, NH, S, SO, もしくは SO₂ で置換されていてもよく、

そして、そこでは、飽和、部分飽和もしくは芳香族でありうる Q は、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、1 もしくはいくつかの位置が、独立にハロ、ヒドロキシル、メルカプチル、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよく、かつトリフルオロメチルもしくはシアノで置換されていてもよいアリールアミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよいアリールアミノ、C₁ - C₄ アルキルスルホニル、C₁ - C₄ アルキルチオ、C₁ - C₄ アルカノイル、オキシ、シアノ、カルボキシ、C₁ - C₆ アルキルもしくはアルナニル、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₅ アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ アルケニルオキシ、フェノキシ、フェニル、シアノフェニル、ベンジルオキシ、ベンジル、アミノ、C₁ - C₄ アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、C₁ - C₄ アルキルカルバモイル、及びジ - (C₁ - C₄) アルキルカルバモイルよりなり、上記の個々の環は 5 - 6 員環であり、そして各複素環は O、N 及び S よりなる群から独立に選ばれた 1 - 6 個の異種原子がいかなる化学的に安定な順序及び酸化状態にある群から任意かつ独立に選ばれた置換基で置換されているものである、群から選ばれた置換基で置換されてもよい。

【請求項 5】

次式の化合物

【化 19】



及び薬剤として許容できるその誘導体

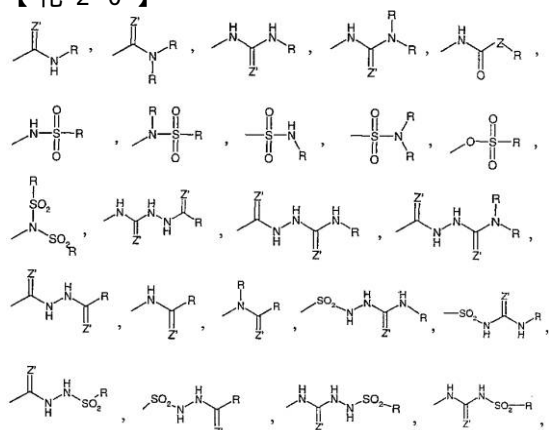
式中、Y は 2, 3 又は 4 の位置に結合しており、

m は 0 - 3 であり、

置換基 - [CH₂]_m - Y は 2, 3 又は 4 の位置に結合しとおり、

X と Y は同一又は異なって、そして独立に、

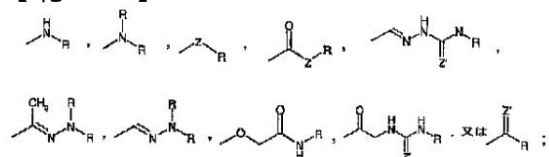
【化 2 0】



もしくはその組合せ、

又は $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖のアルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、該アルキル、アルケニルもしくはアルキニルは 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、Y はさらに、Q、

【化 2 1】



であってもよく、

式中、Z' は O, S, N(CN), CH(NO₂) もしくは N(NO₂) であり、

Z は O もしくは S であり、そして

R は独立に

Q、

もしくは $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは 1 以上の炭素原子が O, N, NH, S, SO, もしくは SO₂ で置換されていてもよく、

そして、そこでは、飽和、部分飽和もしくは芳香族でありうる Q は、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、1 もしくはいくつかの位置が、独立にハロ、ヒドロキシル、メルカプチル、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよく、かつトリフルオロメチルもしくはシアノで置換されていてもよいアリールアミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよいアリールアミノ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルカノイル、オキシ、シアノ、カルボキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルもしくはアルナニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_5$ アルコシカルボニル、 $C_1 - C_4$ アルケニルオキシ、フェノキシ、フェニル、シアノフェニル、ベンジルオキシ、ベンジル、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、ジ- ($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ アルキルカルバモイル、及びジ- ($C_1 - C_4$) アルキルカルバモイルよりなり、上記の個々の環は 5 - 6 員環であり、そして各複素環は O, N 及び S よりなる群から独立に選ばれた 1 - 6 個の異種原子がいかなる化学的に安定な順序及び酸化状態にある群から任意かつ独立に選ばれた置換基で置換されているものである、群から選ばれた置換基で置換されてもよい。

但し、R が Q、又は Q で置換された $C_1 - C_6$ アルキルもしくはアルケニル、又は Q で置換

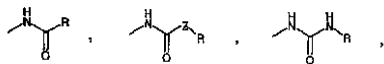
されさらに 1 以上のヒドロキシルもしくはオキシ基で置換された $C_1 - C_6$ アルキルもしくはアルケニルであって、

m は 0 であり、そして

Y が 3 の位置に結合している場合には、

X と Y の両方が

【化 2 2】

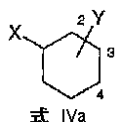


もしくはこれらの組合せではない。

【請求項 6】

次式の化合物

【化 2 3】

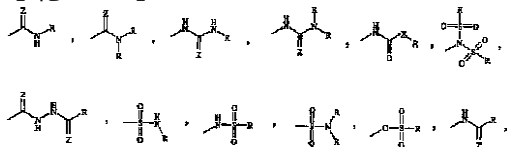


及び薬剤として許容できるその誘導体

式中、Y は 2, 3 又は 4 の位置に結合していて、

X と Y は同一又は異なって、そして独立に、

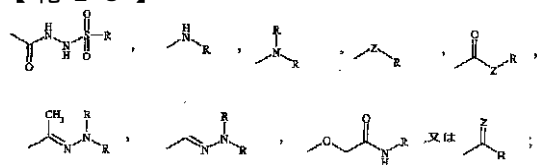
【化 2 4】



もしくはその組合せ、

又は $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、Y はさらに、Q,

【化 2 5】



であってもおく、

式中、Z は O もしくは S であり、そして

R は独立に

Q、

もしくは $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは 1 以上の炭素原子が O, N, NH, S, SO, もしくは SO_2 で置換されていてもよく、

そして、そこでは、Q は、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、飽和、部分飽和もしくは芳香族であってもよく、そして 1 もしくはいくつかの位置がハロ、ヒドロキシ、メルカプチル、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、 $C_1 - C_6$ 直鎖もしくは分岐鎖のアルキルもしくはアルケニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシもしくはアルケニルオキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、アミノもしくはアセチルであって、個々の環は 5 - 6

員環であり、そして各複素環はO, N, Sもしくはその組合せからなる群より選ばれた1 - 6個の異種原子を含んでいる。

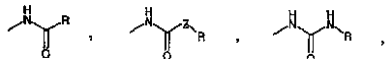
但し、

RがQ、又はQで置換されたC₁ - C₆直鎖もしくは分岐鎖アルキルもしくはアルケニル、又はQで置換されさらに1以上のヒドロキシルもしくはオキシ基で置換されたC₁ - C₆直鎖もしくは分岐鎖アルキルもしくはアルケニルであり、そして、

Yが3の位置に結合している場合には、

XとYの両方が

【化26】

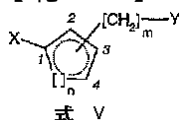


もしくはこれらの組合せではない。

【請求項7】

次式の化合物

【化27】



及び薬剤として許容できるその誘導体

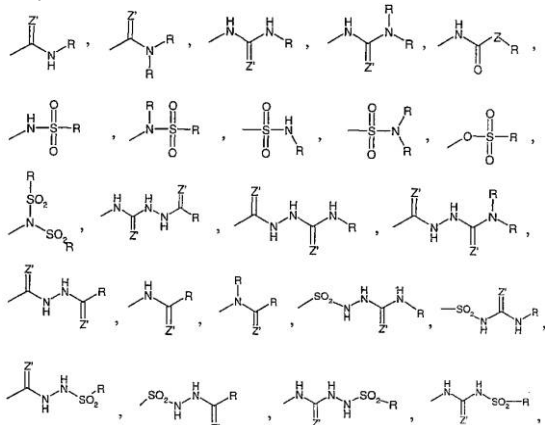
式中、nは1であって、飽和又は部分飽和である中央の5員炭素環が形成され、

mは0 - 3であり、

置換基 - [CH₂]_m - Yは、上記の中央の炭素環の2, 3又は4の位置に結合しており、

XとYは同一又は異なって、そして独立に、

【化28】

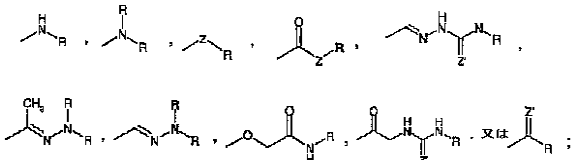


もしくはその組合せ、

又はC₁ - C₆の直鎖もしくは分岐鎖のアルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、該アルキル、アルケニルもしくはアルキニルは1もしくはいくつかの位置がQで置換されており、そして、1もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、

そして、Yはさらに、Q、

【化29】



であってもよく、

式中、 Z' は O , S , $N(CN)$, $CH(NO_2)$ もしくは $N(NO_2)$ であり、

Z は O もしくは S であり、そして

R は独立に

Q 、

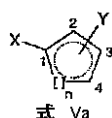
もしくは $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは 1 以上の炭素原子が O , N , NH , S , SO , もしくは SO_2 で置換されていてもよく、

そして、そこでは、飽和、部分飽和もしくは芳香族でありうる Q は、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、1 もしくはいくつかの位置が、独立にハロ、ヒドロキシル、メルカプチル、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよく、かつトリフルオロメチルもしくはシアノで置換されていてもよいアリールアミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよいアリールアミノ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルカノイル、オキソ、シアノ、カルボキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルもしくはアルニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_5$ アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$ アルケニルオキシ、フェノキシ、フェニル、シアノフェニル、ベンジルオキシ、ベンジル、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、ジ - ($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ アルキルカルバモイル、及びジ - ($C_1 - C_4$) アルキルカルバモイルよりなり、上記の個々の環は 5 - 6 員環であり、そして各複素環は O 、 N 及び S よりなる群から独立に選ばれた 1 - 6 個の異種原子がいかなる化学的に安定な順序及び酸化状態にある群から任意かつ独立に選ばれた置換基で置換されているものである、群から選ばれた置換基で置換されてもよい。

【請求項 8】

次式の化合物

【化 30】



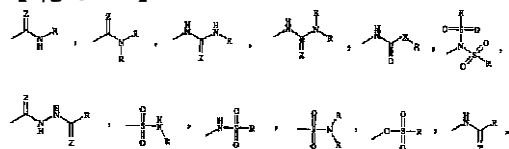
及び薬剤として許容できるその誘導体

式中、 n は 1 であって、飽和又は部分飽和である中央の 5 員炭素環が形成され、

Y は上記の中央の炭素環の 2 , 3 又は 4 の位置に結合しており、

X と Y は同一又は異なって、そして独立に、

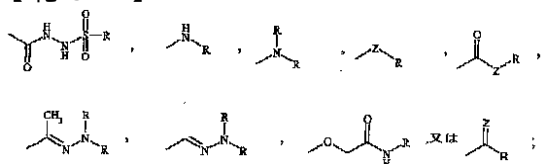
【化 31】



もしくはその組合せ、

又は $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、 Y はさらに、 Q ,

【化 3 2】



であってもよく、

式中、ZはOもしくはSであり、そして

Rは独立に

Q、

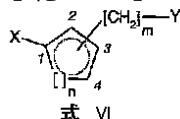
もしくは $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その1もしくはいくつかの位置がQで置換されており、そして、1もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは1以上の炭素原子がO, N, NH, S, SO, もしくは SO_2 で置換されていてもよく、

そして、そこでは、Qは、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、飽和、部分飽和もしくは芳香族であってもよく、そして1もしくはいくつかの位置がハロ、ヒドロキシ、メルカプチル、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、 $C_1 - C_6$ 直鎖もしくは分岐鎖のアルキルもしくはアルケニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシもしくはアルケニルオキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、アミノもしくはアセチルであって、個々の環は5 - 6員環であり、そして各複素環はO, N, Sもしくはその組合せからなる群より選ばれた1 - 6個の異種原子を含んでいる。

【請求項 9】

次式の化合物

【化 3 3】



式 VI

及び薬剤として許容できるその誘導体

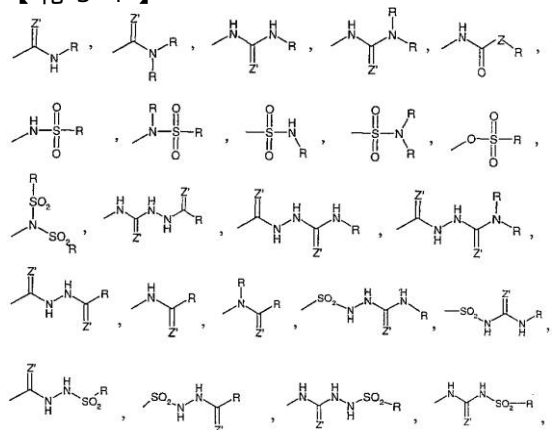
式中、nは2であって、飽和又は部分飽和である中央の6員炭素環が形成され、

mは0 - 3であり、

置換基 - $[CH_2]_m - Y$ は、上記の中央の炭素環の2, 3又は4の位置に結合しており、

XとYは同一又は異なって、そして独立に、

【化 3 4】

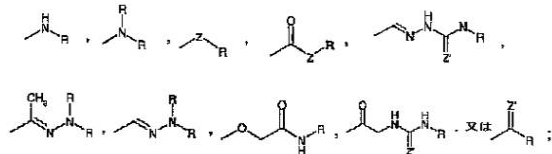


もしくはその組合せ、

又は $C_1 - C_6$ の直鎖もしくは分岐鎖のアルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって

、該アルキル、アルケニルもしくはアルキニルは 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、
そして、Y はさらに、Q、

【化 3 5】



であってもよく、

式中、Z' は O, S, N(CN), CH(NO₂) もしくは N(NO₂) であり、

Z は O もしくは S であり、そして

R は独立に

Q、

もしくは C₁ - C₆ の直鎖もしくは分岐鎖の低級アルキル、アルケニルもしくはアルキニルであって、その 1 もしくはいくつかの位置が Q で置換されており、そして、1 もしくはいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチルもしくはカルボニル酸素で置換されていてもよく、そして、そこでは 1 以上の炭素原子が O, N, NH, S, SO, もしくは SO₂ で置換されていてもよく、

そして、そこでは、飽和、部分飽和もしくは芳香族でありうる Q は、単環、二環もしくは三環の炭素環もしくは複素環であって、1 もしくはいくつかの位置が、独立にハロ、ヒドロキシル、メルカプチル、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよく、かつトリフルオロメチルもしくはシアノで置換されていてもよいアリールアミノカルボニル、ハロゲン化されていてもよいアリールアミノ、C₁ - C₄ アルキルスルホニル、C₁ - C₄ アルキルチオ、C₁ - C₄ アルカノイル、オキソ、シアノ、カルボキシ、C₁ - C₆ アルキルもしくはアルナニル、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₅ アルコシカルボニル、C₁ - C₄ アルケニルオキシ、フェノキシ、フェニル、シアノフェニル、ベンジルオキシ、ベンジル、アミノ、C₁ - C₄ アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、C₁ - C₄ アルキルカルバモイル、及びジ - (C₁ - C₄) アルキルカルバモイルよりなり、上記の個々の環は 5 - 6 員環であり、そして各複素環は O、N 及び S よりなる群から独立に選ばれた 1 - 6 個の異種原子がいかなる化学的に安定な順序及び酸化状態にある群から任意かつ独立に選ばれた置換基で置換されているものである、
群から選ばれた置換基で置換されてもよい。

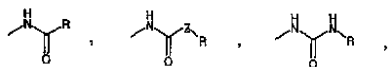
但し、R が Q、又は Q で置換された C₁ - C₆ アルキルもしくはアルケニル、又は Q で置換されさらに 1 以上のヒドロキシルもしくはオキソ基で置換された C₁ - C₆ アルキルもしくはアルケニルであって、

m は 0 であり、そして

Y は前記の中央の炭素環の 3 の位置に結合している場合には、

X と Y の両方が

【化 3 6】



もしくはこれらの組合せではなく、

そして、さらに R が Q、又は Q でモノ置換されたメチルであって、

m は 0 であり、そして

Y は前記 6 員炭素環の 2 の位置に結合し、

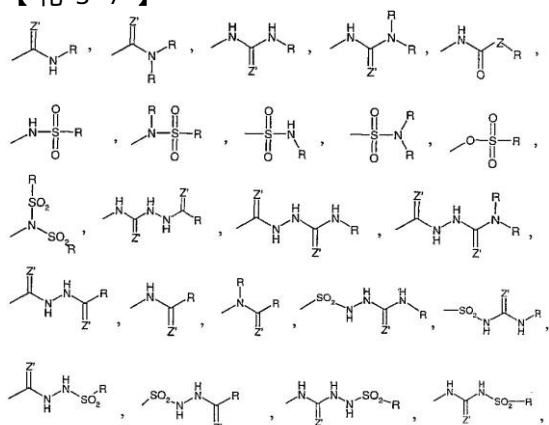
そしてこの炭素環が部分飽和である場合には、

X と Y の両方が - (CO) - NH - R ではない。

【請求項 10】

X と Y が独立に、

【化 37】



からなる群から選ばれたものである、請求項 1, 2, 4, 7 又は 9 のいずれか 1 項による化合物

【請求項 11】

X 又は Y の一方が Q である請求項 10 による化合物

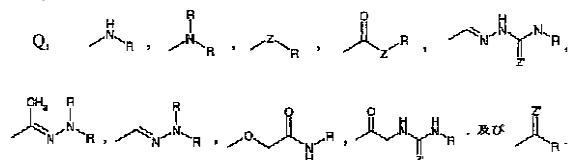
【請求項 12】

X 又は Y の一方における R が Q で置換された $C_1 - C_6$ 直鎖又は分岐鎖の低級アルキル、アルケニル又はアルキニルであって、その 1 又はいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチル又はカルボニル酸素で置換されている請求項 10 による化合物

【請求項 13】

Y が、

【化 38】

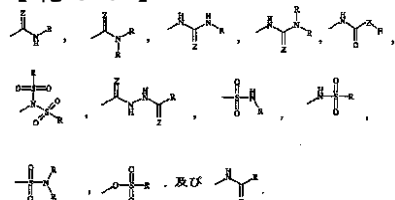


からなる群から選ばれたものである請求項 1, 2, 5, 7 又は 9 のいずれか 1 項による化合物

【請求項 14】

X 及び Y が、独立に

【化 39】



からなる群から選ばれたものである請求項 3, 6 又は 8 のいずれか 1 項による化合物

【請求項 15】

X か Y の一方における R が Q である請求項 14 の化合物

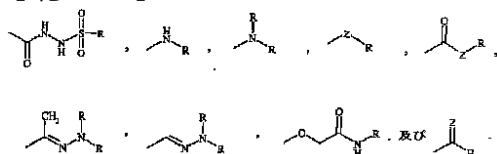
【請求項 16】

X 又は Y の一方における R が Q で置換された $C_1 - C_6$ 直鎖又は分岐鎖の低級アルキル、アルケニル又はアルキニルであって、その 1 又はいくつかの位置がヒドロキシル、メルカプチル又はカルボニル酸素で置換されている請求項 14 の化合物

【請求項 17】

Y が、Q

【化 4 0】



からなる群から選ばれたものである請求項 3 , 6 又は 8 のいずれか 1 項による化合物

【請求項 1 8】

X 及び置換基 - [C H ₂] _m - Y がシス配置に結合している請求項 5 による化合物

【請求項 1 9】

X 及び置換基 - [C H ₂] _m - Y がトランス配置に結合している請求項 5 による化合物

【請求項 2 0】

X 及び Y がシス配置に結合している請求項 6 による化合物

【請求項 2 1】

X 及び Y がトランス配置に結合している請求項 6 による化合物

【請求項 2 2】

X 及び置換基 - [C H ₂] _m - Y がシス配置における前記の中央の炭素環に結合している請求項 7 による化合物

【請求項 2 3】

X 及び置換基 - [C H ₂] _m - Y がトランス配置における前記の中央の炭素環に結合している請求項 7 による化合物

【請求項 2 4】

X 及び Y がシス配置における前記の中央の炭素環に結合している請求項 8 による化合物

【請求項 2 5】

X 及び Y がトランス配置における前記の中央の炭素環に結合している請求項 8 による化合物

【請求項 2 6】

X 及び置換基 - [C H ₂] _m - Y がシス配置に結合している請求項 9 による化合物

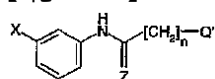
【請求項 2 7】

X 及び置換基 - [C H ₂] _m - Y がシス配置に結合している請求項 9 による化合物

【請求項 2 8】

次式の化合物

【化 4 1】



式 VII

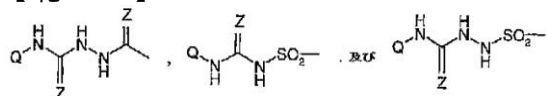
及び薬剤として許容できるその誘導体

式中、Z は O 又は S であり、

n は 2 - 6 であり、

X は、

【化 4 2】



からなる群から選ばれたものであり、そして Q と Q ' は独立に、飽和、部分飽和又は芳香族でありうる 5 - 6 員炭素又は複素環であり、1 又はいくつかの異種原子が存在するならばそれは独立に O , N 及び S からなる群から選ばれたものであり、そして、そこでは Q は 1 又はいくつかの位置がハロ又はトリフルオロメチルで置換されていてもよい、

【請求項 2 9】

化合物 1 : [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] - N - (3 - { [(4 - メトキシフェニル) スルホニル] [(4 - メチルフェニル) スルホニル] アミノ } フェニル) ホルムアミド ;

化合物 2 : [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] - N - (3 - { ビス [(4 - メチルフェニル) スルホニル] アミノ } フェニル) ホルムアミド ;

化合物 3 : [(3 , 5 - ジクロロフェニル) - N - (3 - { [(4 - メトキシフェニル) スルホニル] [(4 - メチルフェニル) スルホニル] アミノ } フェニル) ホルムアミド ;

化合物 4 : (3 - { ビス [(3 , 5 - ジクロロフェニル) スルホニル] アミノ } フェニル) [(4 - メトキシフェニル) スルホニル [(4 - メチルフェニル) スルホニル]] アミン ;

化合物 5 : ビス [(3 , 5 - ジクロロフェニル) スルホニル] (3 - { [ナフチルアミノ] チオキソメチル } アミノ } フェニル) アミン ;

化合物 6 : N - (3 - { ビス [(3 , 5 - ジクロロフェニル)] スルホニル] アミノ } フェニル) [(2 , 6 - ジクロロフェニル) アミノ] ホルムアミド ;

化合物 7 : N - (3 - { ビス [3 , 5 - ジクロロフェニル] スルホニル] アミノ } フェニル) [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] ホルムアミド ;

化合物 8 : (3 , 5 - ジクロロフェニル) - N - { (3 - [ビス (2 - ナフチルスルホニル) アミノ] フェニル) ホルムアミド ;

化合物 8 a : N - (3 - { ビス [(3 , 5 - ジクロロフェニル) スルホニル] アミノ } フェニル) (3 , 5 - ジクロロフェニル) ホルムアミド ;

化合物 9 : (3 - { ビス [(3 , 5 - ジクロロフェニル) スルホニル] アミノ } フェニル) ビス (2 - ナフチルスルホニル) アミン ;

化合物 10 : (3 - { ビス [(3 , 5 - ジクロロフェニル) スルホニル] アミノ } フェニル) ビス (4 - メトキシフェニル) スルホニル] アミン ;

化合物 11 : (ナフチルアミノ) [2 - { [ナフチルアミノ] チオキソメチル } アミノ] シクロヘキシル) アミノ] メタン - 1 - チオン ;

化合物 12 : { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } ({ 2 - [({ [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } チオキソメチル) アミノ] シクロヘキシル } アミノ) メタン - 1 - チオン ;

化合物 13 : [(4 - ヨードフェニル) アミノ] { [2 - ({ [(4 - ヨードフェニル) アミノ] チオキソメチル } アミノ) シクロヘキシル } アミノ] メタン - 1 - チオン ;

化合物 14 : [(3 , 4 - ジクロロフェニル) アミノ] { [2 - ({ [3 , 4 - ジクロロフェニル) アミノ] チオキソメチルアミノ) シクロヘキシル] アミノ } メタン - 1 - チオン ;

化合物 15 : [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] { [2 - ({ [3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] チオキソメチル } アミノ) シクロヘキシル] アミノ } メタン - 1 - チオン ;

化合物 15 a : シス - [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] - N - (2 - { [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] カルボニルアミノ } シクロヘキシル) ホルムアミド ;

化合物 16 : シス - [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] - N - (4 - { [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] カルボニルアミノ } シクロヘキシル) ホルムアミド ;

化合物 17 と 19 : N - (3 , 5 - ジクロロフェニル) [3 - ({ [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] チオキソメチル } アミノ) シクロペンチル] ホルムアミド ;

化合物 18 : (1 S , 3 R) - N - (3 , 5 - ジクロロフェニル) [4 - ({ [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] チオキソメチル } アミノ) シクロペンチル] - 2 - エニル] ホルムアミド ;

化合物 20 : [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] ({ 3 - [2 , 2 - ビス (4 - クロロフェニル) ビニル] フェニル } アミノ) メタン - 1 - チオン ;

化合物 21 : ({ 3 - [2 - アザ - 2 - (ジフェニルアミノ) ビニル] フェニル } アミノ

) [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] メタン - 1 - チオン ;

化合物 22 : 3 - ({ [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] チオキソメチル } アミノ) フェニル 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ペンタフルオロベンゼンスルホネート ;

化合物 23 : 1 - { 3 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジルオキシ] フェニル } - 5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 1 , 4 - ジオキソ - 2 , 3 , 5 - トリアザペンタン ;

化合物 24 : N - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - { 3 - [(3 , 5 - ジクロロフェニル) カルボニルアミノ] フェノキシ } エタナミド ;

化合物 25 : 3 - [(3 , 5 - ジクロロフェニル) カルボニルアミノ] フェニル 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ペンタフルオロベンゼンスルホネート ;

化合物 26 : { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } - N - (3 - フェノキシフェニル) ホルマミド ;

化合物 27 : [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] - N - (2 - { [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] カルボニルアミノ } フェニル) ホルマミド ;

化合物 28 : [(3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] { [2 - ({ [3 , 5 - ジクロロフェニル) アミノ] チオキソメチル } アミノ) フェニル] アミノ } メタン - 1 - チオン ;

化合物 29 : (4 - ヨードフェニル) - N - { 2 - [(4 - ヨードフェニル) カルボニルアミノ] フェニル } ホルマミド ;

化合物 30 : 1 - { 3 - [(3 - ベンジルオキシ) フェニルカルボキサミド] ベンゾイル } - 2 - (3 , 5 - ジクロロベンゾイル) ヒドラジン ;

化合物 31 : 1 - { 3 - [(3 - ベンジルオキシ) フェニルカルボキサミド] ベンゾイル } - 2 - (3 , 4 - ジクロロベンゼンスルホニル) ヒドラジン ;

化合物 32 : 1 - { [1 - アザ - 2 - オキソ - 7 - (3 - トリフルオロメチルフェニル)] ヘプチル } - 3 - { [5 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - オキソ 2 , 3 , 5 - トリアザ - 4 - チオ] ペンチル } ベンゼン ;

化合物 33 : 1 - { 3 - [(5 - フェニル) パレロイルアミノ] ベンゾイル } - 4 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) チオセミカルバジド ;

化合物 34 A : 1 - [3 - (6 - フェニルペンタノイルアミノ) - ベンゼンスルホニル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) チオウレア ;

化合物 34 B : 1 - [3 - (6 - フェニルペンタノイルアミノ) - ベンゼンスルホニル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ウレア ;

化合物 35 : 1 - [3 - (6 - フェニルペンタノイルアミノ) - ベンゼンスルホニル] - 4 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) チオセミカルバジド ;

化合物 36 : L - N - [3 - (6 - フェニルヘキサノイルアミノ) ベンゾイル] プロリン 3 , 4 - ジクロロベンザミド ;

化合物 37 : 1 - { 3 - [(7 - フェニル) ヘプタノイルアミノ] ベンゾイル } - 4 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) チオセミカルバジド ;

化合物 38 : 1 - { [1 - アザ - 2 - オキソ - 6 - (チエン - 2 - イル)] ヘキシル } - 3 - { [5 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - オキソ - 2 , 3 , 5 - トリアザ - 4 - チオ] ペンチル } ベンゼン ;

化合物 39 : N - { 3 - [(1 E) - 2 - アザ - 2 - ({ [(3 , 4 - ジクロロフェニル) アミノ] チオキソメチル } アミノ) ビニル] フェニル } - 5 - フェニルペンタナミド ;

化合物 40 A : 5 - フェニル - 吉草酸 { 3 - [5 - (3 , 4 - ジクロロフェニルアミノ) - [1 , 3 , 4] チアディアゾル - 2 - イル] - フェニル } - アミド ;

化合物 40 B : 5 - フェニル - 吉草酸 { 3 - [5 - (3 , 4 - ジクロロフェニルアミノ) - [1 , 3 , 4] オキサディアゾル - 2 - イル] - フェニル } - アミド ;

化合物 41 : 1 - [(6 - フェニル - 1 - アザ - 2 - オキソ) ヘキシル] - 3 - { [(アダマント - 1 - イル) - 1 - オキソ - 2 , 3 , 5 - トリアザ - 4 - チオ] ペンチル } - ベンゼン ;

化合物 42 : 1 - [(6 - フェニル - 1 - アザ - 2 - オキソ) ヘキシル] - 3 - { [5

- (3, 4 - ジクロロフェニル) - 1, 5 - ジアザ - 2, 4 - オキソ] ペンチル}ベンゼン;

化合物 43: 1 - {4 - [(5 - フェニル)ペンタノイルアミノ]ベンゾイル} - 4 - (3, 4 - ジクロロフェニル)チオセミカルバジド;

化合物 44: N - {3 - [3 - (3, 5 - ジクロロ - フェニルジ) - スルホニル - ウレイド] - フェニル} - Di (3, 5 - ジクロロ - ベンゼンスルホナミド); 及び

化合物 45: 1 - {3 - [6 - (3 - トリフルオロメチルフェニル)ヘキサノイルアミノ] - ベンゼンスルホニル} - 3 - (3, 4 - ジクロロフェニル)チオウレア
からなる群から選ばれた化合物

【請求項 30】

(i) 請求項 2 の式 II の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 31】

(i) 請求項 3 の式 IIa の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 32】

(i) 請求項 4 の式 III の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 33】

(i) 請求項 5 の式 IV の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 34】

(i) 請求項 6 の式 IVa の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 35】

(i) 請求項 7 の式 V の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 36】

(i) 請求項 8 の式 Va の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 37】

(i) 請求項 9 の式 VI の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 38】

(i) 請求項 38 の式 VII の化合物、及び

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤
からなる薬剤組成物

【請求項 39】

(i) 請求項 1 の式 I の化合物

(ii) 薬剤として許容できる基剤、希釈剤又は賦形剤、及び

(iii) 毛髪、成長促進剤、脱毛抑制剤、抗生物質、ふけ症防止剤、抗炎症剤、殺シラミ剤、止痒剤、麻酔薬、角質溶解剤、抗脂漏剤、抗坐瘡剤及び毛染剤からなる群から選ばれ

た添加剤

からなる薬剤組成物

【請求項40】

さらに毛髪、成長促進剤、脱毛抑制剤、抗生物質、ふけ症防止剤、抗炎症剤、殺シラミ剤、止痒剤、麻酔薬、角質溶解剤、抗脂漏剤、抗坐瘡剤及び毛染剤からなる群から選ばれた添加剤を含む請求項30 - 38のいずれか1項による薬剤組成物